

⑤ Int. Cl.

⑥ 日本分類

⑦ 日本国特許庁

⑧ 特許出願公告

C 07 c 103/38

16 B 61

A 61 k 7/00

16 B 602.5

A 61 k 9/06

31 A 0

30 C 52

特 許 公 報

昭49-20762

④公告 昭和49年(1974)5月27日

発明の数 1

(全2頁)

1

2

② 2-高級アチルアミド-6-高級アチル-D-グルコースの製造法

①特 願 昭45-115326

②出 願 昭45(1970)12月21日 5

③発 明 者 松村由夫

三鷹市上連雀9の38の16

同 戸張芳男

東京都足立区西新井6の17の2

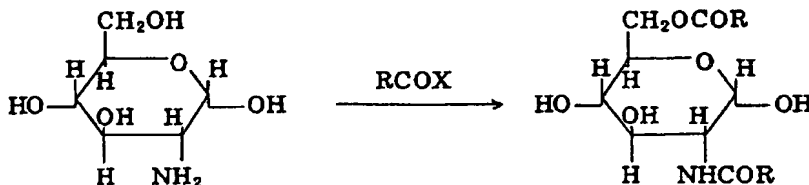
④出 願 人 株式会社日本ケミカル

東京都港区芝5の4の1

⑤代 理 人 弁理士 谷山輝雄 外3名

発明の詳細な説明

本発明は2-アミノ-D-グルコースの2位の*15



但し

R: 高級脂肪酸残基 (C₈~C₁₇)

X: ハロゲン

を表わす。

即ち本発明物質は2-アミノ-D-グルコース又はその酸塩を塩基性有機溶剤に溶解させ、高級脂肪酸ハライドを作用させて有利に2-高級アチルアミド-6-高級アチル-D-グルコースの製造方法である。塩基性有機溶剤とは例えばピリジン、トリエチルアミン、モルフォリン等を指す。

上記の反応方法は2-アミノ-D-グルコース、1モルを塩基性有機溶剤に溶解させ、高級脂肪酸ハライド2モルを作用せしめ内温60~90℃の範囲にて反応させる。反応終了時一部未反応原料の2-アミノ-D-グルコースを分離し、水洗後

*アミノ基及び6位の水酸基へ高級脂肪酸ハライドを作用させる2-高級アチルアミド-6-高級アチル-D-グルコースの製造法に関するものである。

本発明により得られた2-高級アチルアミド-6-高級アチル-D-グルコースは文献未記載の新規物質であり淡白色粉末結晶で、原料の2-アミノ-D-グルコースよりは溶解性が良好である。本発明物質は特に生化学上重要な代謝経路の一部門を占め、皮膚に対して安定でかつアレルギー性を起さず優れた活性を有する。

上記の特異な点を利用し医薬品の軟膏基剤及び一般化粧品に基剤添加剤等に幅広く利用される。本発明物質の製造法は次式で示される。

メチルアルコールから再結晶を行う。と有利に2-高級アチルアミド-6-高級アチル-D-グルコースが製造される。

実施例 1

2-パルミチルアミド-6-O-パルミチル-D-グルコースの製造法

攪拌機を備えたコルベンに2-アミノ-D-グルコース5g(0.0231モル)をピリジンに溶解させ、次にパルミチン酸クロライド12.6g(0.0462モル)を滴下する。

滴下終了後、温度70~80℃にて3時間反応を行う。反応終了後溶媒を減圧留去し冷所放置し白色結晶を得る。濾過し希塩酸水次に水洗を充分行う。メタノールにて再結。

融点 114~115℃ 収量 1.18g

3

元素分析値 $C_{38}H_{73}NO_7 = 65.6012$

炭素 理論値 69.62% 実験値 69.94%

水素 理論値 11.20% 実験値 11.79%

窒素 理論値 2.14% 実験値 2.09%

実施例 2

2-ミリスチールアミド-6-O-ミリスチール-D-グルコースの製造法

攪拌機を備えたコルベンに、2-アミノ-D-グルコース 5g (0.0231モル) をピリジンに溶解させ、次にミリスチン酸クロライド 1.14g (0.0462モル) を滴下する。

滴下終了後、温度 70~80℃ にて 3 時間反応を行う。反応終了後溶媒を減圧留去し冷所放置し

4

て白色結晶を得る。濾過し希塩酸水、次に水洗を充分行う。メタノールにて再結。

融点 112~113℃ 収量 10.3g

元素分析値 $C_{34}H_{65}NO_7 = 59.9898$

5 炭素 理論値 68.07% 実験値 68.65%

水素 理論値 10.91% 実験値 11.21%

窒素 理論値 2.33% 実験値 2.29%

⑦特許請求の範囲

1 2-アミノ-D-グルコース又はその酸塩に高級脂肪酸ハライドを作用せしめることを特徴とする、2-高級アチルアミノ-6-高級アチル-D-グルコースの製造法。

Best Available Copy